

## ▼ネオドパストン配合錠・△メネシット配合錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 レボドパ・カルビドパ (U) levodopa/carbidopa 【分類】 パーキンソニズム治療剤

【単位】 △100mg 錠 (1錠中レボドパ100mg+カルビドパ10mg) ▼250mg 錠 (1錠中レボドパ250mg+カルビドパ25mg)

【常用量】 ■標準維持量：レボドパとして1回200～250mg, 1日3回 [最大1500mg/日]

■レボドパ未服用患者：レボドパ量として1回100～125mg, 1日100～300mgより開始し, 毎日又は隔日にレボドパ量として100～125mg増量して最適投与量を定め維持量とする

■レボドパ既服用患者：レボドパ単味製剤の服用後, 少なくとも8時間の間隔をおいてから, レボドパ1日維持量の約1/5量に相当するレボドパ量を目安として初回量を決め1日3回投与

【用法】1日3回

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (3)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし (3,10,12)

【特徴】レボドパに脱炭酸酵素阻害剤のカルビドパを配合した製剤。配合によりレボドパの血中濃度を高く保つことができ, レボドパ投与量を1/5に減量できる。カルビドパは血液・脳門門を通過せず, 脳内に取り込まれたレボドパのドパミンへの転換には影響を及ぼさないため脳内のドパミン量を増加させる。カルビドパ自身では単独投与では薬理作用を示さない。

【主な副作用・毒性】悪性症候群, 錯乱, 幻覚, 鬱状態, 胃潰瘍・十二指腸潰瘍の悪化, 溶血性貧血, 悪性黒色腫, 病的賭博など

【吸収】levodopaは吸収率高い (11) 半錠投与では吸収率が上昇 (U) カルビドパ40～88% (11)

【F】90% (13,14) 60～90% (レボドパ) カルビドパはレボドパのFを2倍にする (Nutt JG, et al: Ann Neurol 18: 537-43,1985) レボドパは中性アミノ酸トランスポータにより吸収されるが, その機構は飽和し, 消化管には芳香族アミノ酸脱炭酸酵素が分布しているため吸収が制限されFは30%であるが, カルビドパの添加により吸収率は上昇する (U)

【tmax】レボドパ1.4hr (13) 2～3hr (U) 【Cmax】125mg単回経口投与後1.7～1.9μg/mL (13)

【代謝】カルビドパはレボドパの脱炭酸反応を抑制することにより血漿クリアランスを1/2にする (Nutt JG, et al: Ann Neurol 18: 537-43,1985) COMTによる3-O-メチルドパを経てホモパニリン酸になる経路が主となる (1)

【排泄】■レボドパ：ほとんどがドパミンの代謝物として70～80%が尿中に排泄される [経口, 24hrまで] (U) ホモパニリン酸が尿中の主代謝物である (U) 糞便中排泄率2% (U) 尿中未変化体排泄率1%以下 (13,14) 5%以下 (10) ■カルビドパ：尿中未変化体排泄率30% (12,U)

【CL】レボドパ23mL/min/kg (13)

【非腎CL/総CL】レボドパ：100% (10)

【t1/2】■レボドパ：5.5hr (1) 0.8～1.6hr (4) 1.4hr (13,14) 1.3hr (11) 0.75～1.5hr (U) ■カルビドパ：2hr (12) 1～2hr (U) 2～3hr (11)

【蛋白結合率】レボドパ：ほとんど結合しない (11) カルビドパ：36% (11)

【Vd】1.7L/kg, 加齢により低下 (レボドパ) (13) 0.65L/kg (レボドパ) 【分布】末梢での代謝により中枢移行率は低いが, 中性アミノ酸トランスポータによりBBBを通過する (U) カルビドパはBBBを通過しない (U)

【MW】197 (レボドパ) 244 (カルビドパ)

【透析性】比較的透析されやすい特徴と思われる (5)

【TDMのポイント】有効治療域0.2～4μg/mL (14) TDMの対象にならない (5) 【O/W係数】levodopa低い (11)

【備考】急激な中止は悪性症候群を発症することがある。

【更新日】20200215

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。